

подвергаться полосы карбонильной, сложноэфирной, гидроксильной групп, двойной связи, ароматического кольца с образованием π -комплекса. Данные изменения свидетельствуют об образовании непрочных комплексов или поверхностных соединений, которые могут ускорять / замедлять или менять направление реакции. Характер изменений в ИК-спектрах может объяснить механизм действия катализатора в кислотно-основных реакциях, предположить структуру переходного комплекса в таких реакциях, как Биджинелли, Кневенагеля, Ганча и др.

Модификация индивидуальных и смешанных оксидов титана-кремния, цинка, магния-кремния в процессе золь-гель синтеза органическими кислотами (в том числе хиральными) позволила увеличить количество активных центров более чем в 3 раза после удаления органической фазы. Продемонстрирована высокая эффективность их использования в качестве катализаторов асимметрической реакции Биджинелли.

В результате проведенного исследования показано, что оксиды алюминия, титана, кремния, цинка и смешанные оксиды титана-кремния, магния-кремния, а также их композиты с органическими кислотами являются перспективными катализаторами органического синтеза с участием карбонильных соединений, мультикомпонентных и асимметрических реакций.

** Работа выполнена при поддержке гранта РФФИ № 18-53-90026-Бел_a.*

УДК 547.466

А. В. Вахрушев, А. М. Дёмин, В. П. Краснов

Институт органического синтеза

им. И. Я. Постовского УрО РАН,

620137, Россия, г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской, 22,

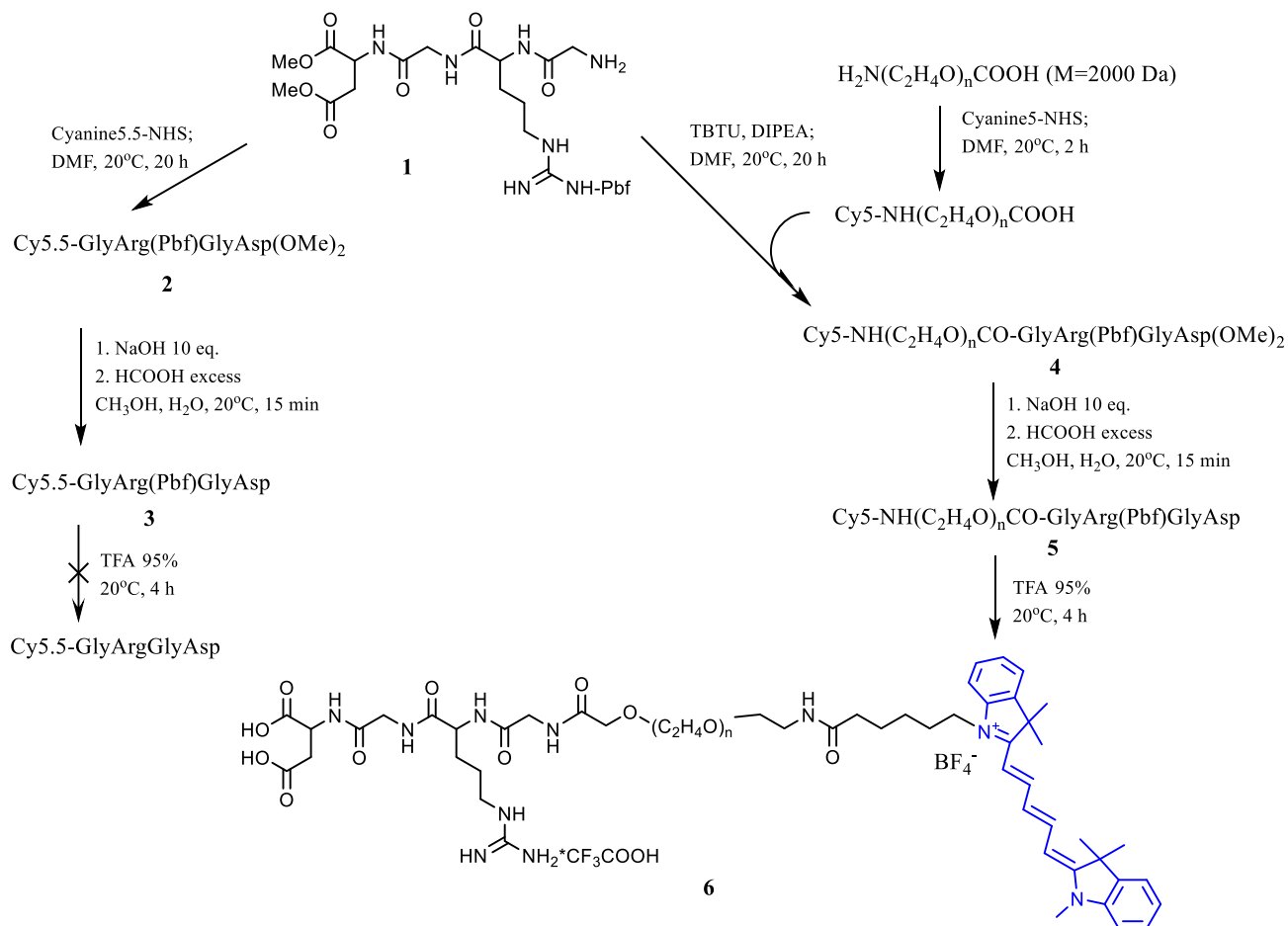
avv@ios.uran.ru

СИНТЕЗ ФЛУОРЕСЦЕНТНЫХ ПРОИЗВОДНЫХ RGD ПЕПТИДА*

Ключевые слова: RGD пептид, цианиновый краситель, полиэтиленгликоль, пептидный синтез.

Производные RGD пептида (*S*-Arg-Gly-*S*-Asp) специфически связываются с интегринами $\alpha_v\beta_3$ и $\alpha_v\beta_5$, распространенными на поверхности опухолевых клеток, что позволяет использовать их в качестве векторных молекул.

Целью данной работы являлся синтез нового производного GRGD пептида, содержащего в качестве флуоресцентной метки цианиновый краситель Cy5. Синтез GRGD пептида **1** осуществляли по аналогии с [1]. Конъюгат с Cy5 **2** получали согласно схеме:



При удалении Pbf группы Arg соединения **3** по стандартной методике наблюдалась потеря флуоресценции продукта реакции вследствие деструкции молекулы красителя. Использование в качестве линкера молекулы ПЭГ позволило отдалить флуоресцентную метку от пептидного фрагмента и получить целевой конъюгат **6**, проявляющий оптические свойства использованного Cy5. Фрагмент ПЭГ также позволил придать гидрофильные свойства целевому соединению **6** и сделать его водорастворимым, что является важным свойством для его применения в биологических экспериментах.

Полученные продукты выделены методом флеш-хроматографии и охарактеризованы данными ¹H ЯМР, УФ-спектроскопии, флуориметрии, масс-спектрометрии и ВЭЖХ.

Наличие флуоресцентной метки Cy5 в полученном конъюгате с GRGD пептидом позволит в дальнейшем изучить его возможности к специфическому связыванию с опухолевыми клетками с использованием оптических методов.

Список литературы

1. *Demin A. M., Vakhrushev A. V., Tumashov A. A. et al.* Synthesis of glutaryl-containing derivatives of GRGD and KRGD peptides // Russ. Chem. Bull. 2019. Vol. 12. P. 2316–2324.

** Работа выполнена в рамках государственного задания № АААА-А19-119012490007-8 и при финансовой поддержке РФФИ (грант № 18-33-00027 мол_а).*

УДК 547.743.1

**А. С. Газизов¹, А. В. Смолобочкин¹,
А. С. Меляшова¹, Р. А. Турманов^{1,2},
А. Р. Бурилов¹, М. А. Пудовик¹**

¹*ИОФХ им. А. Е. Арбузова – обособленное структурное
подразделение ФИЦ КазНЦ РАН,
420088, Россия, г. Казань, ул. Ак. Арбузова, 8,
agazizov@iopc.ru,*

²*Казанский национальный исследовательский
технологический университет,
420015, Россия, г. Казань, ул. К. Маркса, 68*

РЕАКЦИИ ПРОИЗВОДНЫХ 4,4-ДИЭТОКСИБУТАН-1-АМИНА С НУКЛЕОФИЛЬНЫМИ РЕАГЕНТАМИ: СИНТЕЗ 2-ЗАМЕЩЕННЫХ ПИРРОЛИДИНОВ*

Ключевые слова: 4-аминобутаналь, внутримолекулярная циклизация, 2-фосфорилпирролидины, 2-гетарилпирролидины.

Производные пирролидина являются одним из наиболее привлекательных классов гетероциклических соединений. Этот структурный фрагмент входит в состав множества биологически активных соединений как природных (алкалоиды никотин, гигрин, аминокислота пролин и т. д.), так и синтетических [1, 2]. Примечательно, что пирролидиновый цикл – один из наиболее часто встречающихся в структуре лекарственных препаратов гетероциклов [3]. Учитывая это, не вызывает удивления значительное количество усилий, приложенных к поиску новых путей синтеза производных пирролидина [4–6].

В настоящем докладе обобщены результаты исследований новых кислотно-катализируемых реакций функционализированных производных